

ラット肺における5-hydroxytryptamine
トランスポートシステムに対する
[³H]6-nitroquipazineの高親和性結合

橋本謙二, 五郎丸毅

Biochemical Pharmacology, 41(11)1679-1682 (1991)

HIGH-AFFINITY[³H]6-NITROQUIPAZINE BINDING TO THE
5-HYDROXYTRYPTAMINE TRANSPORT SYSTEM IN RAT LUNG

Kenji HASHIMOTO and Tsuyoshi GOROMARU

ABSTRACT [³H]6-Nitroquipazine bound to rat lung membranes at 37° with a dissociation constant (*K_d*) of $0.310 \pm 0.13 \text{ nM}$ and a maximal number of binding sites (*B_{max}*) of $1752 \pm 334 \text{ fmol/mg protein}$ (mean \pm SD, *N*=4). The binding was saturable, of high affinity and sodium dependent. Drug inhibition studies indicated that [³H]6-nitroquipazine binding in the lung is similar to that already reported in the rat brain and human platelets. Scatchard analysis indicated that 5-hydroxytryptamine (5-HT) inhibited [³H]6-nitroquipazine binding to rat lung membranes in a competitive manner. The present results suggest that [³H]6-nitroquipazine binding sites in the rat lung are associated with the uptake system of 5-HT.

抄録 ラットの肺膜標品に対する6-nitroquipazine(6-NQ)の結合について検討した。その結果, 生理的条件下において6-NQは解離定数 (*K_d*) $0.310 \pm 0.13 \text{ nM}$, 最大結合点数 (*B_{max}*) $1752 \pm 334 \text{ fmol/mg 蛋白}$ と特定の結合することが明らかとなった。この結合には飽和性, 高親和性ならびにナトリウム依存性が認められた。阻害剤の影響を検討した結果, 肺における6-NQの結合は既に報告しているラット脳やヒト血小板における結合と同様であった。肺膜標品との結合を解析したところ, 6-NQの結合に対してセロトニン (5-HT) は競合阻害を示し, 6-NQのラット肺における結合部位は5-HT再吸収系と密接に関連していることが明らかとなった。